

(19)



JAPANESE PATENT OFFICE

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number: **2001288047 A**

(43) Date of publication of application: **16.10.01**

(51) Int. Cl

A61K 7/06
A61K 31/517
A61K 31/568
A61K 31/7076
A61K 45/00
A61P 17/14

(21) Application number: **2000099525**

(22) Date of filing: **31.03.00**

(71) Applicant: **SHISEIDO CO LTD**

(72) Inventor: **NAKAZAWA YOSUKE**
OGO MASASHI
TAJIMA MASAHIRO

(54) **COMPOSITION FOR SCALP AND HAIR**

safety.

(57) Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a composition for scalp and hair, excellent in effects for growing the hair and preventing the depilation, also excellent in preventing effects on scurf and itching, and having high

SOLUTION: This composition for scalp and the hair contains testosterone 5α -reductase inhibitor and adenosines such as adenosine.

COPYRIGHT: (C)2001,JPO

(19)日本国特許庁（J P）

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号
特開2001－288047
(P2001－288047A)

(43)公開日 平成13年10月16日(2001. 10. 16)

(51)Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テーマト* (参考)
A 6 1 K 7/06		A 6 1 K 7/06	4 C 0 8 3
31/517		31/517	4 C 0 8 4
31/568		31/568	4 C 0 8 6
31/7076		31/7076	
45/00		45/00	
審査請求 未請求 請求項の数4 O L (全 8 頁) 最終頁に続く			

(21)出願番号	特願2000－99525(P2000－99525)	(71)出願人	000001959 株式会社資生堂 東京都中央区銀座7丁目5番5号
(22)出願日	平成12年3月31日(2000. 3. 31)	(72)発明者	中沢 陽介 神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株 式会社資生堂第一リサーチセンター内
		(72)発明者	尾郷 正志 東京都中央区銀座7丁目5番5号 株式会 社資生堂内
		(74)代理人	100103160 弁理士 志村 光春
		最終頁に続く	

(54)【発明の名称】 頭皮頭髮用組成物

(57)【要約】

【課題】 養毛効果および脱毛防止効果に優れ、フケ・カユミ防止効果にも優れている、安全性の高い頭皮頭髮用組成物を提供すること。

【解決手段】 テストステロン5 α －リダクターゼ阻害剤と、アデノシン等のアデノシン類とを含有する頭皮頭髮用組成物を提供することにより、上記課題を解決し得ることを見い出した。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤、並びに、アデノシン、アデノシン5'-リン酸およびアデノシン5'-リン酸の塩からなる群のアデノシン類から選ばれる1種または2種以上を含有する頭皮頭髮用組成物。

【請求項2】 テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤が、アセンヤク、アチコリア、イエルバルイサ、イチイ、インチン、ウォロ、ウイキョウ、ウスベニアオイ、エイジツ、オルティガニグラ、オンジ、カゴソウ、カコチャ、カシュウ、カッコウアザミ、カノコソウ、ガラナ、カルドサント、カンゾウ、キササゲ、キンセンカ、キンモクセイ、ケイガイ、ケンゴシ、ゲンノショウコ、クアチャララーテ、クサノオウ、クマセバ、ゴバイシ、ゴボウシ、コリアンダー、サイカチ、サイコ、サンシシ、サンショウ、シャクヤク、シャゼンシ、ジャンカン、ジョウザン、セドロソ、センソ、ソクハクヨウ、ソヨウ、ダイオウ、ダウトラワス、チャンカピエドラ、チョウジ、ニガキ、ビンロウジ、マチコ、モッカ、ヤクモソウ、ヤマハギ、ヨクイニン、レグロ、ロジン、ワタおよびペパーミントからなる群から選ばれた一種もしくは二種以上の植物の溶媒抽出エキス、オキシンドロン、ならびに／または、フィナステリドである、請求項1記載の頭皮頭髮用組成物。

【請求項3】 テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤の含有量が、頭皮頭髮用組成物全量に対して0.001～10.0質量%である、請求項1または2記載の頭皮頭髮用組成物。

【請求項4】 アデノシン類の含有量が、頭皮頭髮用組成物全量に対して乾燥固形分として0.0001～10.0質量%である、請求項1～3のいずれかの請求項記載の頭皮頭髮用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、外用組成物のうち、特に、頭皮や頭髮において用いる頭皮頭髮用組成物に関する発明である。

【0002】

【従来の技術】 頭皮頭髮用組成物には様々な種類があり、様々な頭皮頭髮状態に対応した製品が毛髪組成物、育毛剤等として開発されている。例えば、頭皮におけるフケやカユミを防止することにより、脱毛を防止する製品が開発されている。

【0003】 頭皮における様々なトラブルは、高齢化社会を迎えた今日では社会的ストレスの増大も伴って増加しつつあり、頭皮におけるトラブルに対応した頭皮頭髮組成物の需要は急増している。

【0004】 一般に、頭部の禿や脱毛、毛の細り、頭皮のフケやカユミ等の原因としては、毛根の皮脂腺等の器官における男性ホルモンの活性化、過剰な皮脂分泌、過

酸化脂質の生成、毛包への血流量の低下およびストレス等が挙げられる。また、丈夫で美しい髪を育てるうえで、十分な毛包への栄養補給が出来ない場合、細毛ややせ毛の原因となる。また、毛包への血流量の低下は、栄養不足や老廃物排泄の機能低下を招く結果となる。このような観点から、頭皮における角質層のターンオーバーや過剰な皮脂分泌等を改善することは、少なくとも頭皮における血流機能の低下を改善することと共に、頭皮および頭髮のトラブルを解決する上で欠かせないポイントとなっている。

【0005】 従来の頭皮頭髮用組成物は、一般に、これらの禿や脱毛の原因と考えられる要素を取り除いたり軽減する作用を持つ物質を配合したものである。例えば、ビタミンB、ビタミンE等のビタミン類、セリン、メチオニン等のアミノ酸類、センブリエキス、アセチルコリン誘導体などの血管拡張剤、紫根エキス等の抗炎症剤、エストラジオール等の女性用ホルモン剤、セファランチンなどの皮膚機能亢進剤等が配合され、禿や脱毛、髪の毛の細りの予防および治療に用いられている。

【0006】

【発明が解決しようとする課題】 しかしながら、これらの成分を少量のみ頭皮頭髮用組成物中に配合しても十分な効果を得ることは難しく、逆に多く配合すると使用部分およびその周辺に不快な刺激感や発赤を伴う傾向が強まるためその配合量には制限があり、必ずしも所望の効果が十分に得られないといった問題点があった。

【0007】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上述の観点を鑑み鋭意研究を重ねた結果、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤とアデノシン類とを組み合わせると、これらの相乗作用により、優れた養毛効果を有すると共に、優れた脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果も有し、安全性・安定性にも優れる頭皮頭髮用組成物が得られることを見出し本発明を完成するに至った。

【0008】 すなわち、本発明は、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤およびアデノシン類を含有する頭皮頭髮用組成物（以下、本頭皮頭髮用組成物ともいう）である。

【0009】 なお、本発明において、「頭皮頭髮用組成物」とは、頭皮や頭髮に対して用いる外用組成物であり、その剤型や形態は、「頭皮頭髮用」という用途からは直接的な制限を受けず、また、化粧品、医薬部外品、医薬品等の、外用組成物の薬事法上の範疇の別を問うものでもない。

【0010】

【発明の実施の形態】 以下、本発明の実施の形態を説明する。本頭皮頭髮用組成物に含有させ得るアデノシン類は、アデノシン、アデノシン5'-リン酸および／またはアデノシン5'-リン酸の塩である。

【0011】アデノシンは、リボヌクレオシドの一つで塩基部分にプリン誘導体であるアデニンを含むものである。アデノシン5'-リン酸は5'-アデニル酸とも呼ばれ、アデノシンのリボースの5'位のヒドロキシル基にリン酸が1分子結合したヌクレオチドである。

【0012】また、アデノシン5'-リン酸の塩において、塩を形成する対イオンとしては、酸と対イオンを形成する物質であればいずれの物質でもよく、例えばナトリウム、カリウム、カルシウム等を挙げることができる。また、アデノシン5'-リン酸の塩としては、その水和物を使用することもできる。

【0013】本頭皮頭髪用組成物において、アデノシン、アデノシン5'-リン酸および／またはアデノシン5'-リン酸の塩は、試薬として市販されているものを使用することもできる。

【0014】本頭皮頭髪用組成物におけるアデノシン類の配合量は、通常は、乾燥固形分として、頭皮頭髪用組成物全量に対して0.0001～10.0質量%、好ましくは、同0.001～5.0質量%である。乾燥固形分として、頭皮頭髪用組成物全量に対して0.0001

質量%未満では所望する養毛効果、脱毛防止効果等が得られず、また、同10.0質量%を超えると製剤上の問題が生じる傾向が認められる。

【0015】本頭皮頭髪用組成物に含有させるテストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤は、テストステロン5 α -リダクターゼのテストステロンに対する作用を抑制する物質であり、本頭皮頭髪用組成物に含有させ得る、好ましいテストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤は、植物、具体的には、アセンヤク、アチコリア、イエルバルイサ、イチイ、インチン、ウォロ、ウイキョウ、ウスベニアオイ、エイジツ、オルティガニグラ、オンジ、カゴソウ、カコチャ、カシュウ、カッコウアザミ、カノコソウ、ガラナ、カルドサント、カンゾウ、キササゲ、キンセンカ、キンモクセイ、ケイガイ、ケンゴシ、ゲンノショウコ、クアチャララーテ、クサノオウ、クマセバ、ゴバイシ、ゴボウシ、コリアンダー、サイカチ、サイコ、サンシシ、サンショウ、シャクヤク、シャゼンシ、ジャンカン、ジョウザン、セドロソ、センソ、ソクハクヨウ、ソヨウ、ダイオウ、ダウトラウス、チャンカピエドラ、チョウジ、ニガキ、ピンロウジ、マチコ、モツカ、ヤクモソウ、ヤマハギ、ヨクイニン、レグロ、ロジン、ワタまたはペパーミントの、溶媒抽出エキス、オキシセンドロン、あるいはフィナステリドである。

【0016】本頭皮頭髪用組成物には、これらのテストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤を、単独で、または、2種以上組み合わせて、配合することができる。上記植物の溶媒抽出エキスは、水または有機溶媒などによる抽出物であり、例えば、上記の植物の地上部、花、種子、果実、葉、根もしくは全草の乾燥粉末または非乾燥裁断物を、水、メタノール、エタノール、プロピレング

リコール、1, 3-ブチレングリコール、ブタノール、クロロホルム、ジクロルエタン、四塩化炭素、酢酸エチルもしくはエーテル、またはこれらの混液で、30～70℃の加温下、1～10時間攪拌抽出し、あるいは、室温で1日～20日間抽出し、濾過し、濾液を濃縮し、さらに減圧濃縮して乾固したものを使用することが出来る。本頭皮頭髪用組成物には、濃縮液の段階の植物の溶媒抽出エキスをすることも、乾固物の段階の植物の溶媒抽出エキスをすることもできる。

【0017】本発明に用いるテストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤の配合量は、通常、頭皮頭髪用組成物全量に対して0.001～10.0質量%であり、好ましくは、0.01～5.0質量%である。頭皮頭髪用組成物全量に対して0.001質量%未満では所望する養毛効果、脱毛防止効果等が得られず、また、同10.0質量%を超えると製剤上配合が困難になる場合や頭皮に不快な刺激感を与える場合、ホルモンの作用を示す場合が認められる。なお、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤が植物の溶媒抽出エキスの場合は、乾固物の質量、または、植物の溶媒抽出エキスが濃縮液の場合、抽出溶媒を除去した後の質量に基づく。

【0018】このように、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤およびアデノシン類を含有する本頭皮頭髪用組成物は、優れた養毛効果および脱毛防止効果を有し、また、頭皮におけるフケ・カユミを十分に防止することができる頭皮頭髪用組成物である。

【0019】なお、本頭皮頭髪用組成物には、上記した必須成分の他に、本発明の効果を損なわない範囲で、通常、外用組成物に用いられる他の成分、例えば、油分、界面活性剤、増粘剤、紫外線吸収剤、酸化防止剤、防腐剤、香料、色素、水、アルコール等の溶媒を必要に応じて適宜配合することができる。

【0020】本頭皮頭髪用組成物は、目的とする剤型に応じて常法により製造することができる。本頭皮頭髪用組成物の採り得る剤型は任意であり、例えば、液状、乳液、軟膏、クリーム、ゲル、エアゾールなど、外用に適用可能な剤型のものであればいずれでもよい。また、その製品形態も任意であり、例えば、トニック、スカルプトリートメント、シャンプー、リンス等の形態で用いられ得る。

【0021】

【実施例】次に、実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明の技術的範囲が、これらの実施例のみに限定されるものではない。なお、以下の実施例において、配合量は、配合対象に対する質量%であり、植物の溶媒抽出物およびアデノシン類については、固形分量として表示している。

【0022】実施例および比較例において使用した植物の溶媒抽出物は、以下の通りである。ウイキョウ抽出物はウイキョウ(*Foeniculum vulgare* Miller)の果実の乾

乾燥物を粉碎し、70%エタノール中で、室温下で、1週間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0023】カシユウ抽出物はツルドクダミ(*Polygonum multiflorum Thunbergii*)の塊根(カシユウ)の乾燥物を細切し、50%エタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0024】カンゾウ抽出物はカンゾウ(*Glycyrrhiza glabra Linne* 又は *Glycyrrhiza uralensis Fisher*)の根及び根茎の乾燥物を細切し、水中で、100℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0025】クアチャララーテ抽出物はクアチャララーテ(*Juliania adstringens*)の樹皮の乾燥物を細切し、メタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0026】コリアンダー抽出物はコリアンダー(*Coriandrum sativum Linne*)の果実の乾燥物を粉碎し、75%エタノール中で、70℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0027】サンショウ抽出物はサンショウ(*Zanthoxylum piperitum De Candolle* 又はその他同属植物)の成熟した果皮の乾燥物を細切し、エタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0028】ジャンカン抽出物はジャンカン(*Sterculia foetida*)の果皮の乾燥物を細切し、酢酸エチル中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0029】チョウジ抽出物はチョウジ(*Syzygium aromaticum Merrill et Perry*)のつぼみの乾燥物をエタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0030】ペパーミント抽出物はペパーミント(*Mentha piperita*)の葉を細切し、50%1, 3-ブチレングリコール中で、20~25℃で1週間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0031】サンシシ抽出物はクチナシ(*Gardenia jasminoides Ellis*)の果実(サンシシ)の乾燥物を粉碎し、ブタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0032】カッコウアザミ抽出物はカッコウアザミ(*Ageratum conyzoides Linne*)の地上部の乾燥物を細切し、70%エタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0033】シャクヤク抽出物はシャクヤク(*Paeonia lactiflora Pallas* 又はその他近縁植物)の根の乾燥物を細切し、90%エタノール中で、50℃加熱下で、5時間抽出した後、濾過し、濾液の溶媒を留去した濃縮物を使用した。

【0034】〔実施例1~10、比較例1~12〕第1表および第2表に示す処方で、下記の製造方法に従い頭皮頭髮用ローションを調製し、さらに、下記の試験により、これらの頭皮頭髮用ローションの養毛効果、脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果を検討した。これらの試験結果も、第1表および第2表に併せて示す。

【0035】

【表1】

第1表

配合成分	配合量(質量%)											
	実施例											
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	
アデノシン	0.2	0.2	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—
アデノシン5'-リン酸	—	—	—	0.2	0.2	0.2	—	—	—	—	—	—
アデノシン5'-リン酸2ナトリウム	—	—	—	—	—	—	0.2	0.2	0.2	—	—	—
アデノシン5'-リン酸2カリウム	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	0.2	—
ウイキョウ抽出物	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
カシュウ抽出物	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
カンゾウ抽出物	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—
クアチャララーテ抽出物	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—
コリアンダー抽出物	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—
サンショウ抽出物	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—
ジャンカン抽出物	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—
チョウジ抽出物	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—
ペパーミント抽出物	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—
オキシセンドロン	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—
フィナステリド	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—
ポリオキシエチレン(40モル)	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
硬化ヒマシ油	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
防腐剤	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
色素	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
香料	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
コハク酸	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
95%エタノール	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0
精製水	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量
養毛効果	++	++	++	+-	++	++	++	++	++	++	+-	++
脱毛防止効果	++	++	++	+-	++	++	++	++	++	++	++	++
カユミ防止効果	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
フケ防止効果	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎	◎

【0036】

【表2】

第2表

配合成分	配合量(質量%)												
	比較例												
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13
アデノシン	0.01	0.002	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
ウイキョウ抽出物	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
カシュウ抽出物	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—	—
カンゾウ抽出物	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—	—
クアチャララーテ抽出物	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—	—
コリアンダー抽出物	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—	—
サンショウ抽出物	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—	—
ジャンカン抽出物	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—	—
チョウジ抽出物	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—	—
ペパーミント抽出物	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2
オキシセンドロン	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—	—
フィナステリド	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	0.2	—
ポリオキシエチレン(40モル)	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
硬化ヒマシ油	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
防腐剤	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
色素	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
香料	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
コハク酸	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量	適量
95%エタノール	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0	30.0
精製水	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量	残量
養毛効果	+	±	—	—	—	+	+	+	—	—	—	—	+
脱毛防止効果	+	±	—	—	—	+	+	+	—	—	—	—	+
カユミ防止効果	1	1	2	2	3	0	1	1	2	2	2	2	1
フケ防止効果	×	×	△	△	△	○	○	○	△	△	△	△	○

【0037】(1) 製造方法

95%エタノールに、アデノシン類、テストステロン5α-リダクターゼ阻害剤、ポリオキシエチレン(40モル)硬化ヒマシ油、防腐剤および香料を溶解させた(エタノール部)。次に、精製水に、コハク酸および色素を

溶解させ、これを、前記エタノール部に加えた後、攪拌することにより、透明液状のローションを得た。

【0038】(2) 養毛効果試験

本頭皮頭髮用組成物の養毛効果を検討するために、トリコグラム試験を行った。被験者は男性で、実施例および

比較例各群10名とした。試料塗布期間は4ヶ月間とし、この試料を1日2回、1回につき2～4mLを頭皮に塗布した。試験開始直前および試験開始から4ヶ月経過後に、それぞれ被験者1名につき、頭頂部から毛髪を無作為に50本抜去し、抜去毛の毛根を顕微鏡下で観察し、毛根の状態から毛根休止期率(%)を計算した。試験開始直前の毛根休止期率に対して、試験開始から4ヶ月経過後の毛根休止期率がどの程度減少したかを算出し、その平均値を求めて、以下の基準で判定した。

【0039】＜判定基準＞

顕著な効果(++)：試験開始直前の毛根休止期率に対して、試験開始から4ヶ月経過後の毛根休止期率が、30%以上(平均値)減少した。

効果あり(+)：試験開始直前の毛根休止期率に対して、試験開始から4ヶ月経過後の毛根休止期率が、20%以上、30%未満(平均値)減少した。

弱い効果(±)：試験開始直前の毛根休止期率に対して、試験開始から4ヶ月経過後の毛根休止期率が、10%以上、20%未満(平均値)減少した。

効果無し(－)：試験開始直前の毛根休止期率に対して、試験開始から4ヶ月経過後の毛根休止期率が、10%未満(平均値)減少した。

【0040】(3) 脱毛防止効果試験

試料使用前後の洗髪による脱毛本数の変化で測定した。被験者は男性で、実施例および比較例各群10名とした。試験期間は6ヶ月間とし、前期の2ヶ月間は試料無塗布の期間、後期4ヶ月間を試料塗布期間とした。試料塗布期間には、試料を1日2回、1回につき2～4mLを頭皮に塗布した。試験期間中には、1日おきに洗髪して抜け毛を回収し、1週間分をまとめて抜け毛本数を数えた。この本数から、洗髪1回あたりの抜け毛本数(平均値)を算出し、前期最終週平均値と後期最終週平均値を比較し、10名の平均値を算出した。この結果を以下の基準で判定した。

【0041】＜判定基準＞

++：抜け毛本数が70本以上(平均値)減少しており、著しい脱毛防止効果が認められた。

＋：抜け毛本数が40本以上(平均値)減少しており、かなりの脱毛防止効果が認められた。

±：抜け毛本数が10本以上(平均値)減少しており、やや脱毛防止効果が認められた。

－：抜け毛本数が10本未満(平均値)の減少または抜け毛数の増加であり、脱毛防止効果は認められなかった。

【0042】(4) フケ・カユミ防止効果試験

特にフケ・カユミを訴える男性を被験者とし、比較例および実施例の各試料につき10名について試験終了後の頭皮のカユミ、及び、試験開始前と終了時におけるフケ量の変化について調査し、試料のフケ・カユミ防止効果を評価した。試料塗布期間は3ヶ月とし、この間薬剤無

添加のシャンプーで1日1回洗髪し、試料を1日2回、1回につき2～4mLを頭皮に塗布した。

【0043】頭皮のカユミについては、各試験者についてその程度を以下の基準に従い判定し、その平均値で評価した。フケ量については、試験開始前および終了時に、被験者より洗髪前に吸引装置により頭部フケを採取し、フケ中のタンパク質量を測定し、試験開始前のフケ量に対し、試験終了時のフケ量の比率を求め、その平均値を算出し、以下の基準に従い評価した。

10 【0044】＜判定基準＞

①カユミ防止効果

3：強いカユミがある。

2：カユミがある。

1：ややカユミがある。

0：カユミはない。

【0045】②フケ防止効果

◎：試験開始前のフケ量に対する試験終了時のフケ量の比率の平均値は70%以下であった。

○：試験開始前のフケ量に対する試験終了時のフケ量の比率の平均値は71%以上、80%以下であった。

△：試験開始前のフケ量に対する試験終了時のフケ量の比率の平均値は81%以上、90%以下であった。

×：試験開始前のフケ量に対する試験終了時のフケ量の比率の平均値は91%以上であった。

【0046】これらの結果から明らかなように、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤とアデノシン類とを配合した、実施例の頭皮頭髪用ローションには、養毛効果、脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果が顕著に認められたが、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤とアデノシン類のいずれか一方のみを配合した比較例のローションは、特に脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果についてその結果が、実施例の結果と比べて、顕著に劣っていた。

【0047】すなわち、テストステロン5 α -リダクターゼ阻害剤とアデノシン類とを組み合わせ配合した本頭皮頭髪用組成物においては、これらの相乗作用により、養毛効果、脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果が顕著に認められることが明らかになった。

【0048】よって、本頭皮頭髪用組成物を、頭皮または頭髪において用いることにより、発毛を促進し、脱毛を防止することができ、さらに、頭皮においてフケ・カユミを防止することができることが明らかとなった。

【0049】以下に、本頭皮頭髪用組成物の処方例を、実施例として示す。なお、いずれの実施例の頭皮頭髪用組成物も、上記の試験(養毛効果試験、脱毛防止効果試験およびフケ・カユミ防止効果試験)において、優れた養毛効果、脱毛防止効果およびフケ・カユミ防止効果が認められた。また、これらの頭皮頭髪用組成物は、安全性・安定性にも優れているものであった。

50 【0050】

〔実施例12〕 ローション

配合成分

95%エタノール	55.0
アデノシン	10.0
サンシシ抽出物	0.5
パントテニルエチルエーテル	1.0
1,3-ブチレングリコール	1.5
ポリオキシエチレン (60モル) 硬化ヒマシ油	1.0
コハク酸	適量
香料および色素	適量
精製水	残量

配合量 (質量%)

＜製造方法＞95%エタノールに、アデノシンを溶解させ、さらにサンシシ抽出物、パントテニルエチルエーテル、1,3-ブチレングリコール、ポリオキシエチレン (60モル) 硬化ヒマシ油および香料を溶解させた (エタノール*

*ル部)。次に、精製水にコハク酸および色素を溶解させ、これを、前記エタノール部に加えた後、攪拌することによって、透明液状のローションを得た。

【0051】

〔実施例13〕 ローション

配合成分

95%エタノール	75.0
アデノシン5'-リン酸	0.03
カッコウアザミ抽出物	1.0
ヒノキチオール	0.2
セファランチン	0.05
ジプロピレングリコール	1.0
ポリオキシエチレン (24モル) ・ポリオキシプロピレン (13モル) デシルテトラデシルエーテル	0.5
乳酸	適量
乳酸ナトリウム	適量
香料および色素	適量
精製水	残量

配合量 (質量%)

＜製造方法＞95%エタノールに、アデノシン5'-リン酸を溶解させ、さらに、カッコウアザミ抽出物、ヒノキチオール、セファランチン、ジプロピレングリコール、ポリオキシエチレン (24モル) ・ポリオキシプロピレン (13モル) デシルテトラデシルエーテルおよび香料を溶※

30 ※解させた (エタノール部)。次に、精製水に、乳酸、乳酸ナトリウムおよび色素を溶解させ、これを、前記エタノール部に加えた後、攪拌することによって、透明液状のローションを得た。

【0052】

〔実施例14〕 ローション

配合成分

95%エタノール	60.0
アデノシン5'-リン酸2ナトリウム	20.0
シャクヤク抽出物	0.3
モノニトログアヤコールナトリウム	1.0
ビタミンB ₆	0.5
6-アミノベンジルプリン	0.5
ペンタデカン酸モノグリセリド	1.0
ポリエチレングリコール400	0.5
ポリオキシエチレン (20モル) 硬化ヒマシ油	1.0
リン酸	適量
香料および色素	適量
精製水	残量

配合量 (質量%)

＜製造方法＞95%エタノールに、アデノシン5'-リン酸2ナトリウムを溶解させ、さらに、モノニトログアヤ

50 コールナトリウム、ビタミンB₆、シャクヤク抽出物、6-アミノベンジルプリン、ペンタデカン酸モノグリセリ

ド、ポリエチレングリコール 4 0 0、ポリオキシエチレン (20モル) 硬化ヒマシ油および香料を溶解させた (エタノール部)。次に、精製水に、リン酸および色素を溶解させ、これを、前記エタノール部に加えた後、攪拌することによって、透明液状のローションを得た。

【 0 0 5 3 】

【発明の効果】本発明により、養毛効果および脱毛防止効果に優れていると共に、フケ・カユミ防止効果にも優れている、安全性の高い頭皮頭髮用組成物が提供される。

フロントページの続き

(51) Int. Cl.⁷

識別記号

F I

テ-マコ-ト* (参考)

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/14

(72) 発明者 田島 正裕

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株
式会社資生堂第一リサーチセンター内

F タ-ム (参考) 4C083 AA111 AA112 AC102 AC292

AC432 AC851 AC852 AD022

AD491 AD492 AD601 AD602

CC31 CC37 DD23 DD27 EE11

EE22 EE23

4C084 AA19 MA63 NA05 NA06 ZA921

ZC202

4C086 AA01 BC46 DA08 GA17 MA02

MA04 NA05 NA06 ZA92 ZC20